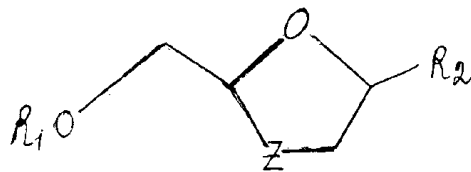


Revendicări:

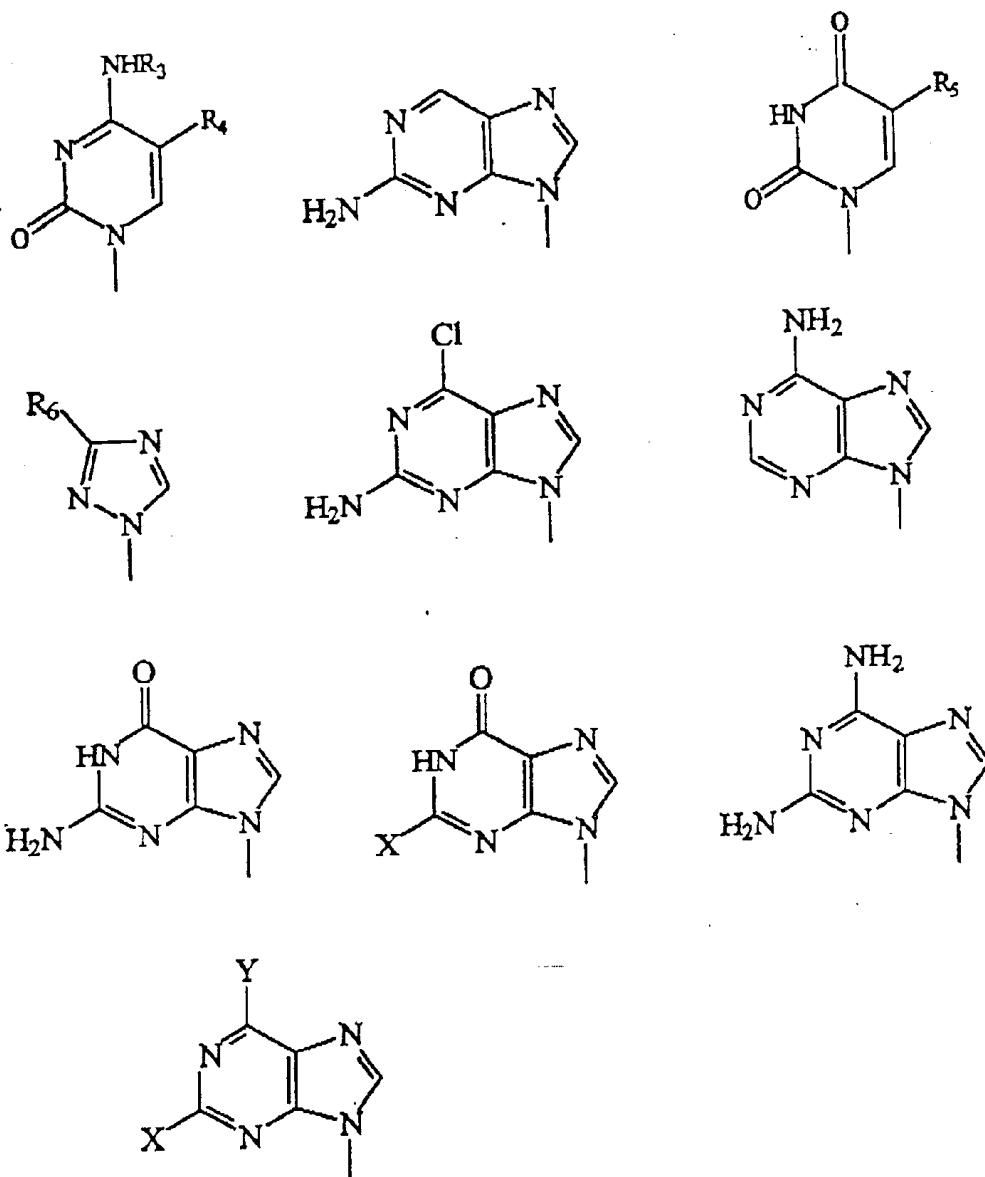
1. 1,3-Oxatiolanul cu formula I, izomerii lui geometrici și optici, amestecurile acestor izomeri:



(I)

unde R_1 reprezintă hidrogen;

R_2 reprezintă un radical selectat



din:

unde R_3 reprezintă hidrogen;

R_4 reprezintă hidrogen, C_{1-6} -alchil sau fluor;

R_5 reprezintă hidrogen sau C_{1-6} -alchil;

R_6 reprezintă carbamoil sau tiocarbamoil, iar

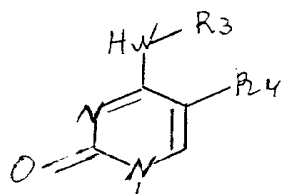
X și Y se aleg independent din hidrogen, brom, clor, fluor, iod, o grupă aminică sau un hidroxil;

Z este selectat dintr-o grupă din S, SO sau SO_2 , și sărurile sau eterii lui farmaceutic acceptabili.

2. Compus cu formula I, conform revendicării 1, caracterizat prin aceea că este un cis-izomer.

3. Compus cu formula I, conform revendicărilor 1 sau 2, caracterizat prin aceea că Z reprezintă S.

4. Compus, conform oricărei din revendicările 1-3, caracterizat prin aceea că R_2 reprezintă radicali cu formula:



unde R_3 reprezintă hidrogen, iar R_4 se alege din hidrogen, C_{1-6} -alchil saturat sau fluor.

5. Compus, conform revendicării 1, caracterizat prin aceea că se alege dintre:

cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-benzoiloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(N⁴-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-hidroximetil-5-(N⁴-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-benzoiloximetil-5-(N⁴-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan;

trans-2-benzoiloximetil-5-(N⁴-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor și

cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-3-oxo-1,3-oxatiolan;

cis-2-hidroximetil-5-(N-dimetilamino-metilencitozină-1'-il)-1,3-oxatiolan;

bis-cis-2-succiniloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(6'-clorpurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan;

trans-2-benzoiloximetil-5-(6'-clorpurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(6'-hidroxipurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(uracil-N-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(uracil-N-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(uracil-N-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-hidroximetil-5-(5'-fluorcitozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și derivații lui farmaceutic acceptabili.

6. Compus cu formula I, conform revendicării 1, care manifestă activitate antivirotică.

7. Cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și derivații lui farmaceutic acceptabili, care manifestă activitate antivirotică.

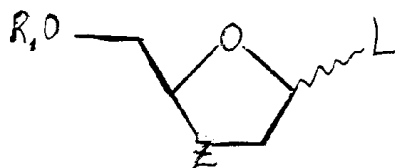
8. Cis-2-hidroximetil-5-(5'-fluorcitozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și derivații lui farmaceutic acceptabili, care manifestă activitate antivirotică.

9. 1,3-Oxatiolan, conform oricărei din revendicările 1-8, în formă de un singur izomer optic.

10. 1,3-Oxatiolan, conform oricărei din revendicările 1-8, în formă de amestec racemic.

11. Compoziție farmaceutică, care manifestă activitate antivirotică, ce conține ingredient activ și excipient, caracterizată prin aceea că în calitate de ingredient activ conține o cantitate efectivă de 1,3-oxatiolan, conform oricărei din revendicările 1-10, sau derivatul lui farmaceutic acceptabil.

12. 1,3-Oxatiolan cu formula VIII, izomerii săi geometrici și optici și amestecurile acestor izomeri:

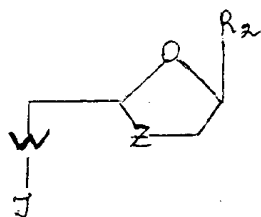


(VIII)

unde R_1 reprezintă hidrogen sau o grupă de protecție hidroxilică,

Z reprezintă S, SO, sau SO_2 ; și L reprezintă alcoxycarbonil, iod, brom, clor sau un radical -OR, în care R este ales din grupa alifatică sau acil aromatică.

13. Derivatul esteric al 1,3-oxatiolanului, conform revendicării 1, izomerii săi geometrici și optici sau amestecurile acestor izomeri cu formula generală IV:

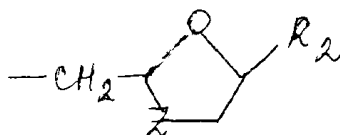


(IV)

unde W reprezintă PO_4^- , SPO_3^- sau $-O-CO-(CH_2)_n-CO-O-$, în care n reprezintă un număr întreg egal cu 1 sau cu 2;

R_2 și Z au semnificațiile determinate anterior; I reprezintă un rest de oxo- sau aminopirimidinonă, care poate fi substituit cu un alchil inferior, sau un rest de 6'-clor- sau 6'-hidroxipurină.

14. 1,3-Oxatiolan, conform revendicării 13, caracterizat prin aceea că I reprezintă o grupă cu formula:



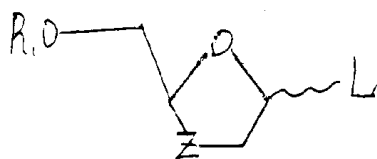
unde R_2 și Z au semnificațiile determinate anterior.

15. Procedeu de obținere a oxatiolanului cu formula I, izomerilor geometrici sau optici sau a amestecurilor lor, sau sărurilor și esterilor farmaceutic acceptabili:



în care:

R_1 reprezintă hidrogen și R_2 și Z au semnificațiile conform revendicării 1, caracterizat prin aceea că se realizează interacțiunea compusului cu formula VIII



(VIII)

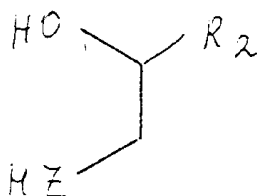
în care:

R_1 reprezintă hidrogen sau o grupă de protecție hidroxilică, Z are semnificația conform revendicării 1, iar L reprezintă o grupă sau un atom substituit cu baza R_2 -H, și, dacă este necesar, compusul obținut poate fi supus la una sau două reacții suplimentare, care includ: (I) eliminarea oricărei grupe de protecție; (II) transformarea compusului cu formula I sau sării lui într-o sare farmaceutic acceptabilă.

16. Procedeu conform revendicării 15, caracterizat prin aceea că grupa L se alege din alcoxicarbonil, iod, brom, clor sau -OR, unde R reprezintă o grupă alchil substituită sau nesubstituită, saturată sau nesaturată sau o grupă acil substituită sau nesubstituită alifatică sau aromatică.

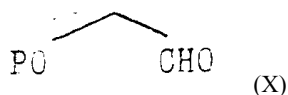
17. Procedeu conform revendicării 15, caracterizat prin aceea că compusul cu formula VIII este adus în reacție cu o bază sililată, purinică sau pirimidinică într-un solvent acceptabil în prezența acidului Lewis, așa ca tetraclorura de titan sau clorura de staniu, sau trimetilsililtriflatul.

18. Procedeu de obținere a oxatiolanului în formă de izomeri geometrici sau optici sau amestecul lui cu formula I sau sărurilor sau esterilor farmaceutic acceptabili, caracterizat prin aceea că se realizează interacțiunea compusului cu formula IX:



(IX)

cu compusul având formula X:



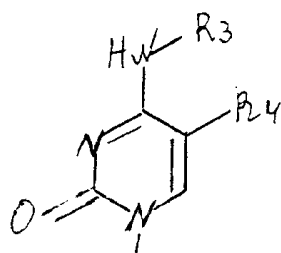
(X)

unde P reprezintă grupa de protecție și, dacă este necesar, compusul obținut poate fi supus la una, sau două reacții suplimentare, care includ: (I) eliminarea oricărei grupe de protecție; (II) transformarea compusului cu formula I sau sării lui într-o sare farmaceutic acceptabilă.

19. Procedeu, conform revendicărilor 15-18, caracterizat prin aceea că compusul cu formula I se obține sub formă de cis-izomer.

20. Procedeu, conform revendicărilor 15-19, caracterizat prin aceea că Z reprezintă S.

21. Procedeu, conform oricărei din revendicărilor 15-20, caracterizat prin aceea că R_2 reprezintă un radical cu formula:



unde R₃ se alege din hidrogen, C₁-C₆-alchil saturat, iar R₄ se alege din hidrogen, C₁-C₆-alchil saturat sau fluor.

22. Procedeu, conform oricărei din revendicările 15-21, caracterizat prin aceea că compusul cu formula I se alege dintre:

cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-benzoiloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(N₄-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-hidroximetil-5-(N₄-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-benzoiloximetil-5-(N₄-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(N₄-acetil-citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor și

cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1-il)-3-oxo-1,3-oxatiolan;

cis-2-hidroximetil-5-(N-dimetilamino-metilencitozină-1'-il)-1,3-oxatiolan;

bis-cis-2-succiniloximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(6'-clorpurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan;

trans-2-benzoiloximetil-5-(6'-clorpurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-1-hidroximetil-5-(6'-hidroxipurină-N-9'-il)-1,3-oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(uracil-N-1'-il)-1,3-oxatiolan ,

trans-2-benzoiloximetil-5-(uracil-N-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil -5-(uracil-N-1'-il)-1,3-

oxatiolan;

cis-2-benzoiloximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan,

trans-2-benzoiloximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan și amestecurile lor;

cis-2-hidroximetil-5-(timină-N-1'-il)-1,3-oxatiolan

și derivații lor farmaceutic acceptabili.

23. Procedeu, conform oricărei din revendicările 15-21, caracterizat prin aceea că compusul cu formula I este cis-2-hidroximetil-5-(citozină-1'-il)-1,3-oxalanul și derivații săi farmaceutic acceptabili.

24. Procedeu, conform oricărei din revendicările 15-23, caracterizat prin aceea că compusul se obține sub formă de un singur izomer optic.

25. Procedeu, conform oric[rei din revendic[rile 15-23, caracterizat prin aceea c[compusul se obține sub form[de amestec racemic.